

(19)日本国特許庁 (JP)

(12) 公表特許公報 (A)

(11)特許出願公表番号

特表平6-505733

第3部門第2区分

(43)公表日 平成6年(1994)6月30日

(51)Int.Cl.
A 61 K 31/415

識別記号
7431-4C

F I

審査請求 未請求 予備審査請求 有 (全3頁)

(21)出願番号 特願平4-506405
(86) (22)出願日 平成4年(1992)3月23日
(85)翻訳文提出日 平成5年(1993)9月24日
(86)国際出願番号 PCT/GB92/00522
(87)国際公開番号 WO92/16208
(87)国際公開日 平成4年(1992)10月1日
(31)優先権主張番号 9106278.6
(32)優先日 1991年3月25日
(33)優先権主張国 イギリス(GB)
(81)指定国 EP(AT, BE, CH, DE,
DK, ES, FR, GB, GR, IT, LU, MC, NL,
SE), AU, CA, JP, KR, US

(71)出願人 スミスクライン・ビーチャム・バブリック・リミテッド・カンパニー
イギリス国ミドルセックス・ティーダブリュ8・9イービー、ブレンフォード、ニューハライズンズ・コート(番地の表示なし)
(72)発明者 ギャザード、ブライアン・ジョージ
イギリス国ロンドン・エスダブリュ1、ホースフェリー・ロード、ディーン・ライル・ストリート、ザ・ウエストミンスター・ホスピタル(番地の表示なし)
(74)代理人 弁理士 青山 葵(外1名)

(54)【発明の名称】 ミクロスボリディア症の治療におけるベンゾイミダゾール駆虫薬の使用

(57)【要約】

ミクロボリディア症の治療におけるベンゾイミダゾール駆虫薬の使用。

1. ミクロスボリディア症の治療用薬物の製造用ベンゾイミダゾール殺虫剤。
2. ベンゾイミダゾール殺虫剤がアルベンダゾールである請求項1記載の使用。
3. 感染される患者がヒト免疫不全ウイルス(HIV)にも感染している請求項2記載の使用。
4. ミクロスボリディア症が下痢の原因となる感染である請求項3記載の使用。

ミクロスボリディア症の治療におけるベンゾイミダゾール殺虫剤の使用

本発明は、ミクロスボリディアによって引き起こされる疾患の治療、特に、ヒト免疫不全ウイルス(HIV)に感染している患者の下痢の治療における、ある種のベンゾイミダゾール化合物の使用に関する。

動物が感染するプロトゾア・ミクロスボリディア(*protozoa microsporidia*)は500種類を超える。急性免疫不全症候群(AIDS)の出現までは、ヒト感染は珍しく、1、2件の報告および歴史に記載されていた。しかししながら、現在、ミクロスボリディア症は、HIV感染個体の小腸において共通しており、下痢の原因と考えられる。アメリカ合衆国における最近の研究では、下痢の原因として他の病原体が記載されていない患者の3分の1は、空腸生検中にミクロスボリディア寄生虫を持つことが判明した[ヒューマン・パラソロジー(Human Pathology), 1990, 21(5): 475-82]。最近、英国の研究では、非常に複雑な形態が見られた[ピーコック(Peacock)ら、ジャーナル・オブ・クリニカル・パラソロジー(J. Clin Path) 1991, 印刷中]。しかしながら、ミクロスボリディア病が下痢の原因において病原体的重要性を有するものであるという重要な証拠は、肝道化學的治療剤での微生物を封殺させる能力、または、別法として、好適な薬物モデルの開発を必要とする。かかる好適な化学的治療剤は、現在でも、入手可能ではない。

本発明は、この要求を満足するものであり、第1の難題において、ヒト免疫不全ウイルス(HIV)に感染している患者における、ミクロスボリディア症の治療用、特に、例えば、下痢の原因となるミクロスボリディア症のようなミクロスボリディア症の治療用薬物の製造において使用するためのベンゾイミダゾール殺虫剤を提供するものである。

より広範囲の難題において、本発明は、ヒト免疫不全ウイルス(HIV)に感

染している患者における、ミクロスボリディア症の治療用、特に、下痢の原因となるミクロスボリディア症のようなミクロスボリディア症の治療用薬物の製造において使用するためのベンゾイミダゾール殺虫剤を提供するものである。

「ベンゾイミダゾール殺虫剤」なる語は、広域殺虫剤として作用することが知られているいずれのベンゾイミダゾール含有薬物をも含むことを意図する。例えば、かかる化合物としては、アルベンダゾールに加えて、フェンベンダゾール、オキシベンダゾール、メベンダゾールおよびバルベンダゾールが挙げられる。

さらなる態様では、本発明は、ミクロスボリディア症の治療が必要な対象に、例えばアルベンダゾールのようなベンゾイミダゾール殺虫剤の有効量を投与することからなる。ミクロスボリディア症の治療方法を提供する。特に、本発明は、ヒト免疫不全ウイルス(HIV)に感染している患者において、ミクロスボリディア症、例えば、下痢の原因となるミクロスボリディア症の治療方法を提供する。

本発明で使用する場合、活性剤は、標準的な医薬品、例えば健利通成剤に簡略化される。

活性剤の好適な用量は、1日当たり100~5000mgの範囲であり、該化合物は、症状を軽減し、かつ、患者の感染からの解放を維持することが必要である限りは、1回以上の離散性投与単位で、1日1回または2回、投与される。用量計量法のサイズ、回数および期間は、もちろん、感染の重複度に左右されるであろう。

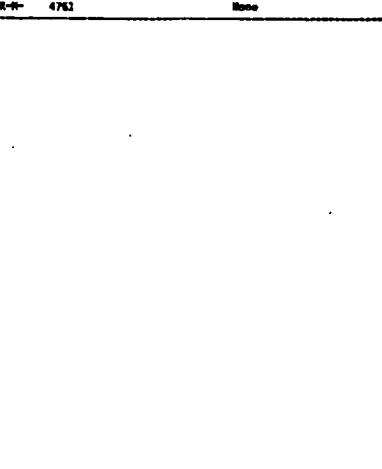
結果

下痢を有し、空腸生検でミクロスボリディア症を示した6体のHIV感染者にて研究を行った。

該患者をアルベンダゾール(400mg, b.i.d.)で、1週間以内で治療し、6体のうち5体は、下痢が完全になくなるという劇的な症候性改善があり、体重低下が阻止された。結果として、2体の患者は、非下痢性の原因で死亡し、1カ月の治療を完了した残りの4体のうち2体は再発した。

これらの患者のうちの5体において治療の後に行った空腸生検によって、ミ

クロスボリディア病の収縮が示されるが、明らかな成熟は阻止され、その結果、相當なメロント期が見られるが、成熟胞子はない。

| 田原国交報官 | | | |
|---|------------------|-------------------------|------------------|
| | | CD 9200522 | SA 5770 |
| <p>This sheet lists the patent family members relating to the patent documents cited in the aforementioned International Search Report. The numbers are as registered in the European Patent Office EPO (i.e. 0779770). The European Patent Office is in no way liable for those patent rights which are merely given for the purpose of information.</p> | | | |
| Patent document cited in search report | Publication date | Patent family member(s) | Publication date |
| FR-A- 4762 | | None | |
|  | | | |